

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Rec'd PCT/PTO 18 FEB 2005  
PCT/JP2003/010401



Applicant's or agent's file reference ONF-4648PCT	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2003/010401	International filing date (day/month/year) 18 August 2003 (18.08.2003)	Priority date (day/month/year) 19 August 2002 (19.08.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D207/16, A61K31/4025, 31/403, 31/404, 314245, 31/427, 31/428, 31/429, 31/437, 31/438, 31/4439, 31/454, 31/5377, 31/541, 45/00, A61P/04, 3/10, 13/08, 17/00, 35/04, 37/00, 37/04		
Applicant ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.		

<p>1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>6</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p>3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:</p> <p>a. <input type="checkbox"/> (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of _____ sheets, as follows:</p> <p><input type="checkbox"/> sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).</p> <p><input type="checkbox"/> sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (sent to the International Bureau only) a total of _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).</p>	
<p>4. This report contains indications relating to the following items:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. I Basis of the report</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. II Priority</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. IV Lack of unity of invention</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. VI Certain documents cited</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VII Certain defects in the international application</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VIII Certain observations on the international application</p>	

Date of submission of the demand 06 February 2004 (06.02.2004)	Date of completion of this report 11 June 2004 (11.06.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/010401

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

☐ This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:

- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))  
☐ publication of the international application (under Rule 12.4)  
☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

☒ The international application as originally filed/furnished

☐ the description:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ the claims:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ the drawings:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_

☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

☐ the description, pages \_\_\_\_\_

☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_

☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_

☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

☐ the description, pages \_\_\_\_\_

☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_

☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_

☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP03/10401

## Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

☐ the entire international application.

☒ claim No. 11

because:

☐ the said international application, or the said claim No. 11 relates to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

The invention of claim 11 pertains to a method for treatment of the human body by therapy.

☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ the claims, or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so inadequately supported by the description that no meaningful opinion could be formed.

☒ no international search report has been established for said claim No. 11

☐ the nucleotide and/or amino acid sequence listing does not comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions in that:

the written form

☐ has not been furnished

☐ does not comply with the standard

the computer readable form

☐ has not been furnished

☐ does not comply with the standard

☐ the tables related to the nucleotide and/or amino acid sequence listing, if in computer readable form only, do not comply with the technical requirements provided for in Annex C-*bis* of the Administrative Instructions.

☐ see Supplemental Box for further details.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP03/10401

**Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**

## 1. Statement

Novelty (N)	Claim	6	YES
	Claims	1-5, 7-10, 12-14	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-10, 12-14	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-10, 12-14	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1) WO, 02/14271, A  
 Document 2) JP, 9-509921, A  
 Document 3) WO, 02/53170, A  
 Document 4) WO, 02/53169, A  
 Document 5) JP, 2002-516318, A  
 Document 6) Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (1996), 6(10), 1163-1166  
 Document 7) Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (1997), 7(13), 1701-1704  
 Document 8) Agricultural and Biological Chemistry (1991), 55(4), 1135-6  
 Document 9) JP, 2-262557, A  
 Document 10) JP, 2-179, A  
 Document 11) Journal of Medicinal Chemistry (1992), 35(3), 490-501  
 Document 12) JP, 2-129168, A  
 Document 13) WO, 90/07502, A  
 Document 14) Journal of Medicinal Chemistry (1991), 34(1), 397-403  
 Document 15) JP, 1-308250, A  
 Document 16) JP, 63-146860, A

The inventions described in claims 1-5, 7-10 and 12-14 do not appear to be novel based on documents 7 and 9-16 cited in the ISR. Documents 7 and 9-16 describe compounds corresponding to the compound in the inventions of this application. The inventions of claims 1-10 and 12-14 do not appear to be novel or to involve an inventive step based on documents 1-6 and 8 cited in the ISR. Documents 1-6 and 8 describe various compounds that are useful as dipeptyl peptidase-IV inhibitors, and the compounds in the inventions of this application are either the same as the compounds described in documents 1-6 and 8 or similar in chemical structure so that they can be easily conceived of by a party skilled in the art.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP03/10401

## Box No. VI Certain documents cited

### 1. Certain published documents (Rule 70.10)

Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
WO 03/57666 A	17.07.2003	26.12.2002	26.12.2001
EX			
WO 03/57144 A	17.07.2003	24.12.2002	26.12.2001
EX			
WO 03/24942 A	27.03.2003	13.09.2002	14.09.2001
EX			

### 2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

Kind of non-written disclosure	Date of non-written disclosure (day/month/year)	Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY**

International application No.

**PCT/JP03/T0401**

**Supplemental Box**

In case the space in any of the preceding boxes is not sufficient.  
Continuation of:

**International Patent Classification**

43/00, C07D277/56, 401/06, 401/14, 403/06, 405/14, 413/14, 417/06, 417/14,  
471/04, 513/04

Rec'd PCT/PTO 18 FEB 2005

## 特 許 協 力 条 約

P C T

REC'D 01 JUL 2004

WIPO

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第1.2条、法施行規則第56条)

[PCT 36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 ONF-4648PCT	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/10401	国際出願日 (日.月.年) 18.08.2003	優先日 (日.月.年) 19.08.2002
国際特許分類 (IPC) Int.Cl <sup>7</sup> C07D207/16, A61K31/4025, 31/403, 31/404, 31/4245, 31/427, 31/428, 31/429, 31/437, 31/438, 31/4439, 31/454, 31/5377, 31/541, 45/00, A61P3/04, 3/10, 13/08, 17/00, 35/04, 37/00, 37/04,		
出願人 (氏名又は名称) 小野薬品工業株式会社		

1. この報告書は、PCT 35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条 (PCT 36条) の規定に従い送付する。	
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>6</u> ページからなる。	
3. この報告には次の附属物件も添付されている。 a <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。  <input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照) <input type="checkbox"/> 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙 b <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)	
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。 <input checked="" type="checkbox"/> 第I欄 国際予備審査報告の基礎 <input type="checkbox"/> 第II欄 優先権 <input checked="" type="checkbox"/> 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 <input type="checkbox"/> 第IV欄 発明の単一性の欠如 <input checked="" type="checkbox"/> 第V欄 PCT 35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 <input checked="" type="checkbox"/> 第VI欄 ある種の引用文献 <input type="checkbox"/> 第VII欄 国際出願の不備 <input type="checkbox"/> 第VIII欄 国際出願に対する意見	

国際予備審査の請求書を受理した日 06.02.2004	国際予備審査報告を作成した日 11.06.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 内藤 伸一	4B 8615
電話番号 03-3581-1101 内線 3448		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第 I 欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、\_\_\_\_\_ 語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査

☐ PCT規則12.4にいう国際公開

☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ

☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項

☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること)

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ

☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項

☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること)

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。



1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☒ 請求の範囲 11

請求の範囲 1 1 の発明は、治療による人体の処置方法に関するものである。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 \_\_\_\_\_ が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

[X] 請求の範囲	11	について、国際調査報告が作成されていない。
-----------	----	-----------------------

<input type="checkbox"/>	提出されていない。
<input type="checkbox"/>	所定の基準を満たしていない。
<input type="checkbox"/>	提出されていない。
<input type="checkbox"/>	所定の基準を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	6	有
	請求の範囲	1-5, 7-10, 12-14	無
進歩性 (IS)	請求の範囲		有
	請求の範囲	1-10, 12-14	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-10, 12-14	有
	請求の範囲		無

## 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

- 文献1) WO 02/14271 A  
 2) JP 9-509921 A  
 3) WO 02/53170 A  
 4) WO 02/53169 A  
 5) JP 2002-516318 A  
 6) Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (1996), 6(10), 1163-1166  
 7) Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (1997), 7(13), 1701-1704  
 8) Agricultural and Biological Chemistry (1991), 55(4), 1135-6  
 9) JP 2-262557 A  
 10) JP 2-179 A  
 11) Journal of Medicinal Chemistry (1992), 35(3), 490-501  
 12) JP 2-129168 A  
 13) WO 90/07502 A  
 14) Journal of Medicinal Chemistry (1991), 34(1), 397-403  
 15) JP 1-308250 A  
 16) JP 63-146860 A

請求の範囲1-5, 7-10, 12-14の発明は、国際調査報告で引用された文献7, 9-16により新規性を有さない。文献7, 9-16には、本願発明化合物に該当する化合物が記載されている。請求の範囲1-10, 12-14の発明は、国際調査報告で引用された文献1-6, 8により新規性及び進歩性を有さない。文献1-6, 8には、ジペプチジルペプチダーゼIV阻害剤として有用な種々の化合物が記載されており、本願発明化合物は、文献1-6, 8記載の上記化合物と同一のものであるか、又は、化学構造上類似するものであって当業者が容易に想到し得たものである。

## 第VI欄 ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/57666 A EX	17. 07. 2003	26. 12. 2002	26. 12. 2001
WO 03/57144 A EX	17. 07. 2003	24. 12. 2002	26. 12. 2001
WO 03/24942 A EX	27. 03. 2003	13. 09. 2002	14. 09. 2001

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 欄の続き

国際特許分類の続き

43/00, C07D277/56, 401/06, 401/14, 403/06, 405/14, 413/14, 417/06, 417/14,  
471/04, 513/04